

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
21. April 2005 (21.04.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/034940 A3

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **A61K 31/404, 31/4045, C07C 243/28, C07D 307/52, 207/32, 405/06, 513/04, 317/58**

Strasse 44, 39120 Magdeburg (DE). KEYNEUROTEK AG ZENIT TECHNOLOGIEPARK [DE/DE]; Leipziger Str. 44, 39120 Magdeburg (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/011644

(72) Erfinder; und

(22) Internationales Anmeldedatum:
15. Oktober 2004 (15.10.2004)

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ANSORGE, Siegfried [DE/DE]; Am Sportplatz 17, 39291 Hohenwarthe (DE). BANK, Ute [DE/DE]; Baumeckerstr. 25, 39418 Stassfurt (DE). NORDHOFF, Karsten [DE/DE]; Salbker Str. 8, 39120 Magdeburg (DE). TÄGER, Michael [DE/DE]; Akazienstr. 29, 39326 Heinrichsberg (DE). STRIGGOW, Frank [DE/DE]; Domblick 49a, 39175 Gerwisch (DE).

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(74) Anwalt: KOEPE, Gerd, L.; Koepe & Partner, Robert-Koch-Str. 1, 80538 München (DE).

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,

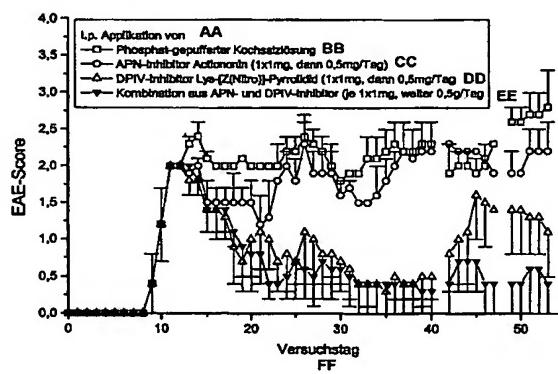
(30) Angaben zur Priorität:
103 48 044.7 15. Oktober 2003 (15.10.2003) DE

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(51) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): INSTITUT FÜR MEDIZINTECHNOLOGIE MAGDEBURG (IMTM) GMBH [DE/DE]; Leipziger

(54) Title: DUAL ALANYL AMINOPEPTIDASE AND DIPEPTIDYL PEPTIDASE IV INHIBITORS FOR FUNCTIONALLY INFLUENCING DIFFERENT CELLS AND FOR TREATING IMMUNOLOGICAL, INFLAMMATORY, NEURONAL AND OTHER DISEASES

(54) Bezeichnung: DUALE ALANYL-AMINOPEPTIDASE- UND DIPEPTIDYLPEPTIDASE IV-INHIBTOREN ZUR FUNKTIONELLEN BEEINFLUSSUNG UNTERSCHIEDLICHER ZELLEN UND ZUR BEHANDLUNG IMMUNOLOGISCHER, ENTZÜNDLICHER, NEURONALER UND ANDERER ERKRANKUNGEN



AA ... I.p APPLICATION OF
BB ... PHOSPHATE-BUFFERED TABLE SALT SOLUTION
CC ... APN-INHIBITOR ACTINONIN (1x1 mg, THEN 0.5mg/day)
DD ... DPIV-INHIBITOR Lys-[2(NITRO)-]PYRROLIDE (1x1 mg, THEN 0.5 mg/day)
EE ... COMBINATION CONSISTING OF APN- AND DPIV-INHIBITORS
(EACH 1x1 mg, THEN 0.5 g/day)
FF ... TEST DAY

(57) Abstract: The invention relates to substances, which specifically inhibit both Ala-p-nitroanilide-cleaving peptidases as well as Gly-Pro-p-nitroanilide-cleaving peptidases, for use in the field of medicine. The invention also relates to the use of at least one substance of this type or of at least one pharmaceutical or cosmetic composition, which contains at least one of the aforementioned substances, for preventing and treating diseases, particularly for preventing and treating diseases with an overshooting immune response (autoimmune disease, allergies and transplant rejections), other chronic inflammatory diseases, neuronal diseases and cerebral damages, skin diseases (inter alia, acne and psoriasis), tumor diseases and special viral infections (inter alia, SARS).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

WO 2005/034940 A3



AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts:

8. Dezember 2005

- (84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart):** ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

-
- (57) Zusammenfassung:** Die vorliegende Erfindung betrifft Substanzen, die sowohl Ala-p-Nitroanilid spaltende Peptidasen als auch Gly-Pro-p-Nitroanilid spaltende Peptidasen spezifisch inhibieren, für die Verwendung in der Medizin. Weiter betrifft die Erfindung die Verwendung mindestens einer derartigen Substanz oder mindestens einer mindestens eine derartige Substanz enthaltenden pharmazeutischen oder kosmetischen Zusammensetzung zur Prophylaxe und Therapie von Erkrankungen, insbesondere zur Prophylaxe und Therapie von Erkrankungen mit überschießender Immunantwort (Autoimmunerkrankungen, Allergien und Transplantatrektionen), von anderen chronisch-entzündlichen Erkrankungen, neuronalen Erkrankungen und zerebralen Schädigungen, Hauterkrankungen (u. a. Akne und Schuppenflechte), Tumorerkrankungen und speziellen Virusinfektionen (u. a. SARS).